



(2,000円)

⑯ 日本国特許庁

公開特許公報

特許願(2)(後記等ナシ)

昭和48年1月24日

特許長官 三宅幸夫 殿

1. 発明の名称

シンキ
新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法

2. 発明者

住所 大分県中津市大学島田字前原555-3
氏名 長谷川 実

(1名)

3. 特許出願人

住所 大阪市東区平野町3丁目35番地
名称 吉富製薬株式会社
(672) 代表者 不破泰

4. 代理人

住所 大阪市東区平野町3丁目35番地
吉富製薬株式会社内
氏名 弁理士(6630)高宮城勝

5. 添付書類の目録

- (1) 明細書 1通
(2) 委任状 1通
(3) 特許願副本 1通

⑪特開昭 49-95997

⑫公開日 昭49.(1974)9.11

⑬特願昭 48-10463

⑭出願日 昭48.(1973)1.24

審査請求 未請求 (全4頁)

府内整理番号

6736 44
6647 49
7167 49

⑮日本分類

16 E621
30 F371.222
30 F932

明細書

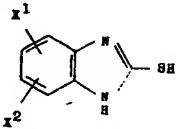
1. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製

造法

2. 特許請求の範囲

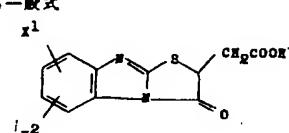
一般式



で表わされる2-ノルカブトベンズイミダゾール化合物と一般式



で表わされる酸無水物を反応させることを特徴とする一般式

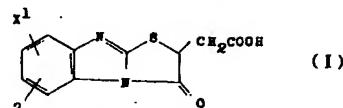


で表わされるチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法。

上記式中 X¹, X² はそれぞれ水素、ハロゲン、低級アルキルまたは低級アルコキシを示し、▲は -CH=CH- または -CHY-CH₂- を示し、ここで Y は活性基である。

3. 発明の詳細な説明

本発明は一般式



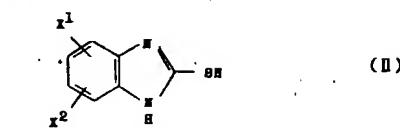
〔式中 X¹, X² はそれぞれ水素、ハロゲン(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、低級アルキル(メチル、エチルなど)または低級アルコキシ(メトキシ、エトキシなど)を示す。〕

で表わされる新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法に関する。

BEST AVAILABLE COPY

本発明方法によれば、一般式(I)の化合物は、

一般式



[式中X¹, X²は前述のとおり]

で表わされる2-メルカブトベンズイミダゾール

化合物と一般式



[式中Aは-C≡C=CH-または-CH=C(CH₃)₂-を示し、

ここではハロゲン、メチルスルホニルオキシ、
p-トリルスルホニルオキシなどの活性基を示す。]

で表わされる酸無水物を反応させるとにより製
造される。

反応は無溶媒あるいは不溶性溶媒（ジオキサン、
テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エテレ

特開 昭49-95997(2)
ングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリ

コールジメチルエーテル等のエーテル類、ジメチ

ルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサ

メチルホスホロアミド等のアミド類、アセトン、

メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、

シクロヘキサン等のケトン類、酢酸エチル、酢

酸ブチル等のエステル類、ギ酸、酢酸、硝酸等の

カルボン酸類、リン酸、ポリリン酸、ベンゼン、

トルエン、キシレン、クメン、リグロイン等の炭

化水素類、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロル

エタン等のハロゲン化炭化水素類等またはこれら

の混合溶媒）中で行なわれる。

反応に際しては、ナトリウムメチラート、カリウ
ムエチラート、カ性ソーダ、カ性カリ、炭酸カリ、
炭酸ソーダ、重炭酸カリ、重炭酸ソーダ、重炭酸
カルシウム、トリエチルアミン、ビリジン、キノ

リン、エーメチルモルホリン等の脱酸剤を用いて
もよく、またメルカブトベンズイミダゾールをあ
らかじめ金属塩（ソーダ塩、カリウム塩、リチウ
ム塩、銀塩、銅塩等）として、反応に供してもよ
い。反応温度は室温から150℃付近で、反応時
間は数時間から數十時間程度である。

得られる化合物は必要に応じて、ナトリウム、カ
リウム、銀、銅、カルシウム、バリウム、トリメ
チルアミン、ビリジン、キノリン等との有機塩、
無機塩として単離精製しても良い。

かくして得られる化合物(I)は植物生長調節
作用を有し、農薬として有用である。

以下に実施例を示して、本発明を具体的に説明
するが、本発明はこれらのみに限定されるもので
はない。

実施例 1

2-カルボキシメチル-3-オキソ-2,3-

ジヒドロチアゾロ[3,2-e]ベンズイミダ

ゾールの製造

方法 1

2-メルカブトベンズイミダゾール3.0g、無
水マレイン酸19.6gをジオキサン100mlに加
え、24時間通風した。反応液を室温に冷却する
と、黄色結晶28.0gを得た。汎液を水1lに注
ぐと、さらに11.0gの結晶を得た。両結晶を合
せ、醇酸より再結晶すると、融点207~209
℃（分解）〔淡褐色の固体に変化〕を示す表層化
合物29.1gを黄色結晶性粉末として得た。

方法 2

2-メルカブトベンズイミダゾール1.00gを
ジメチルホルムアミド200mlに溶解し、かくは
ん下に、無水マレイン酸6.6gを含むジメチル

ルムアミド溶液 8.0 mL を 2 時間を経て滴下し、
4.0 時間かくはんした。淡褐色透明の反応液を濾
過し、得られた褐色結晶を母液より分別結晶する
と、原料 2-メルカプトベンズイミダゾール 1.0
g と表題化合物 2.2 g を得た。

方法 1

2-メルカプトベンズイミダゾール 1.0 g、2-
ブロモコハク酸無水物 1.6 g、炭酸カリ 2.9 g
をジオキサン 100 mL に加え、6.0 時間かくはん
通流した。熱時不溶物を沪去し、沪液を室温まで
冷却した後、水 1 L に注ぎ、析出する結晶を母液
から再結晶すると、表題化合物 1.6 g を得た。

方法 2

2-メルカプトベンズイミダゾール 1.0 g、無
水マレイン酸 1.0 g をよく混和し、封管中で 12
0~140°C に 6 時間保つた。得られた固態物を

特開 昭49-95997(3)
母液から再結晶すると、表題化合物 1.3 g を得た。

前記実施例と同様な方法により、次の化合物が
製造される。

◎ 2-カルボキシメチル-6-(または 7-)

クロロ-3-オキソ-2,3-ジヒドロチアゾ
ロ[3,2-e]ベンズイミダゾール、融点 17
6~178°C (分解)

◎ 2-カルボキシメチル-6,7-ジメトキシ
-3-オキソ-2,3-ジヒドロチアゾロ[3
,2-e]ベンズイミダゾール、融点 220°C 以
上

◎ 2-カルボキシメチル-6-(または 7-)

メチル-3-オキソ-2,3-ジヒドロチアゾ
ロ[3,2-e]ベンズイミダゾール、

代理人 弁理士 高宮城 勝

6. 前記以外の発明者

住所 大分県中津市 1345 (無町名)

氏名 示容第・尚

手 続 補 正 書

昭和 48 年 4 月 18 日

特許庁長官三宅幸夫殿

1. 事件の表示

昭和 48 年特許願第 10463 号

2. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法

3. 補正をする者

事件との関係	特許出願人
住所	大阪市東区平野町 3 丁目 35番地
名 称	吉富製薬株式会社
(6 7 2)	代表者 不破 奎

4. 代 理 人

住所	大阪市東区平野町 3 丁目 35番地
名 称	吉富製薬株式会社内
氏 名	弁理士 高宮城 勝
(6 6 3 0)	

5. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

6. 補正の内容

特開 昭49-95997(4)

明細書第8頁14行目の「ベンズイミダゾール
」の後に「融点173~175℃(分解)」を
挿入する。

以 上

BEST AVAILABLE COPY